

# BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

15.07.04



REC'D 30 AUG 2004  
WIPO PCT

## PRIORITY DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

### Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

**Aktenzeichen:** 103 57 714.9

**Anmeldetag:** 9. Dezember 2003

**Anmelder/Inhaber:** BASF Aktiengesellschaft, 67056 Ludwigshafen/DE

**Bezeichnung:** 2-Substituierte Pyrimidine

**IPC:** C 07D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 2. Juli 2004  
Deutsches Patent- und Markenamt  
Der Präsident  
Im Auftrag

Schäfer

## Patentansprüche

## 1. 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I



5 in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n eine ganze Zahl von 1 bis 5, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt;

10 L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A")-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A,

15 m 0, 1 oder 2;

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Nitro, Cyanato, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

25 25 wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

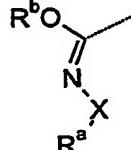
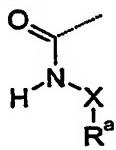
30 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl;

R<sup>2</sup> kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether -(—O—), Carbonyl -(C=O)-, Thio -(—S—), Sulfoxyl -(—S[=O]—) oder Sulfenyl -(—SO<sub>2</sub>—) oder eine weitere Amino -(-N(R<sup>a</sup>)- Gruppe, wobei R<sup>a</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy enthalten kann;

10 R<sup>3</sup> Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyloxy, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkinylreste von R<sup>3</sup> durch Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl substituiert sein können;

15 R<sup>4</sup> einer der Formeln



entspricht, in denen

X eine direkte Bindung, -(C=O)-, -(C=O)-NH-, -(C=O)-O-, -O-, -NR<sup>c</sup>-, -CH<sub>2</sub>O-(C=O)-, -C=C-(C=O)-, wobei der jeweils linke Molekülteil an das Stickstoffatom gebunden ist;

R<sup>a</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl oder Benzyl;

R<sup>b</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl;

R<sup>c</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, Benzyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Acyl

bedeuten,

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup> und/oder R<sup>c</sup> ihrerseits eine bis vier Gruppen R<sup>w</sup> tragen können:

R<sup>w</sup> Halogen, Cyano, OR<sup>x</sup>, NHR<sup>x</sup>, SR<sup>x</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Acylamino, [1,3]Dioxolane-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, [1,3]Dioxane-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, wobei

R<sup>x</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl oder Benzyl bedeutet.

2. 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I nach Anspruch 1, in der die Index und die  
5 Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n eine ganze Zahl von 1 bis 3, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt;

10 L Halogen, Cyano, Methyl, Methoxy, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A,

15 A,A' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten Heterocycius, enthaltend ein oder zwei Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

20 wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

25 R<sup>1</sup>,R<sup>2</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl;

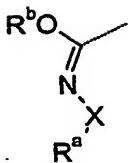
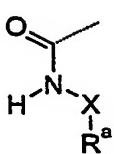
30 R<sup>2</sup> kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

35 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether -(—O—) oder eine weitere Amino-(—N(R<sup>a</sup>)- Gruppe, wobei R<sup>a</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy enthalten kann;

R<sup>3</sup> Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Haloalkyl;

R<sup>4</sup> einer der Formeln

4



entspricht, in denen

- 5            X        eine direkte Bindung,  $-(\text{C}=\text{O})-$ ,  $-(\text{C}=\text{O})-\text{NH}-$ ,  $-(\text{C}=\text{O})-\text{O}-$ ,  $-\text{O}-$ ,  $-\text{NR}^{\text{c}}-$ ,  
wobei der jeweils linke Molekülteil an das Stickstoffatom gebunden ist;

10             $\text{R}^{\text{a}}$     Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl;

15             $\text{R}^{\text{b}}$     Wasserstoff,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkyl, Allyl oder Propargyl;

$\text{R}^{\text{c}}$     Wasserstoff, Methyl oder  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Acyl  
bedeuten,  
wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von  $\text{R}^{\text{a}}$ ,  $\text{R}^{\text{b}}$  und/oder  
15             $\text{R}^{\text{c}}$  ihrerseits eine oder zwei Gruppen  $\text{R}^{\text{w}}$  tragen können:

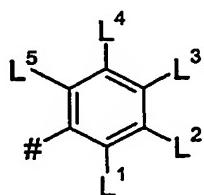
20             $\text{R}^{\text{w}}$     Halogen,  $\text{OR}^{\text{x}}$ ,  $\text{NHR}^{\text{x}}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_6$ -Alkyl,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkoxy carbonyl,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Acylamino,  
[1,3]Dioxolane- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, [1,3]Dioxane- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, wobei

25             $\text{R}^{\text{x}}$     Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl bedeutet.

3.            2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei  $\text{R}^{\text{3}}$  Chlor, Cyano, Methyl oder  
Methoxy bedeutet.

25            4.            2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei  $\text{R}^{\text{a}}$  Wasserstoff und  $\text{R}^{\text{b}}$  Was-  
serstoff oder  $\text{C}_1\text{-C}_6$ -Alkyl bedeuten.

30            5.            2-Substituierte Pyrimidine nach einem der Ansprüche 1 bis 6, in der die durch  $\text{L}_n$   
substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



B

steht, worin  $\#$  die Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidin-Gerüst ist und

B

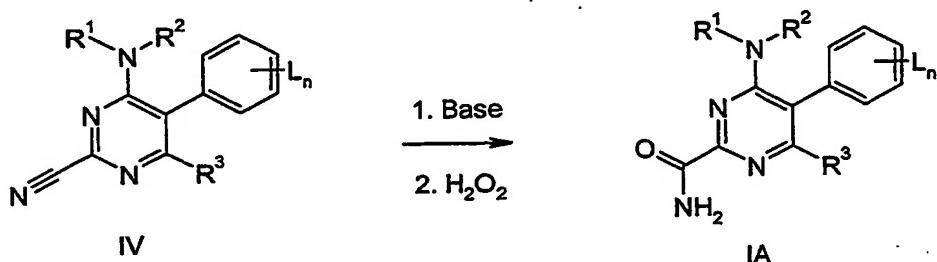
L<sup>1</sup> Fluor, Chlor, CH<sub>3</sub> oder CF<sub>3</sub>;

L<sup>2</sup>,L<sup>4</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, CH<sub>3</sub> oder Fluor;

L<sup>3</sup> Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, NH-C(=O)CH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-C(=O)CH<sub>3</sub> oder COOCH<sub>3</sub> und

5 L<sup>5</sup> Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH<sub>3</sub> bedeuten.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen IA, durch Hydrolyse



10

der Nitrile der Formel IV, wobei die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und L sowie der Index n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, dadurch gekennzeichnet, dass in Gegenwart einer Base und Wasserstoffperoxid hydrolysiert wird.

15

7. Pestizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

20

8. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

## 2-Substituierte Pyrimidine

## Beschreibung

5 Die Erfindung betrifft 2-substituierte Pyrimidine der Formel I,



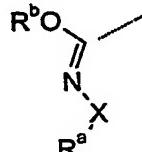
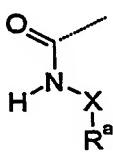
in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- 10 n eine ganze Zahl von 1 bis 5, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt;
- L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A")-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A,
- 15 m 0, 1 oder 2;
- A,A', A" unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Nitro, Cyanato, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;
- 20 25 wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;
- 30 R<sup>1</sup>,R<sup>2</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl;
- 35 R<sup>2</sup> kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether-(—O—), Carbonyl -(C=O)-, Thio-(—S—), Sulfoxyl-(—S[=O]—) oder Sulfenyl-(—SO<sub>2</sub>—) oder eine weitere Amino-(—N(R<sup>a</sup>)- Gruppe, wobei R<sup>a</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy enthalten kann;

10 R<sup>3</sup> Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyloxy, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkinylreste von R<sup>3</sup> durch Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Aloxycarbonyl substituiert sein können.

15

R<sup>4</sup> einer der Formeln

entspricht, in denen

20 X eine direkte Bindung, -(C=O)-, -(C=O)-NH-, -(C=O)-O-, -O-, -NR<sup>c</sup>-, -CH<sub>2</sub>-O-(C=O)-, -C=C-(C=O)-, wobei das jeweils linke Atom des Brückenglieds an das Stickstoffatom gebunden ist;

25 R<sup>a</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl oder Benzyl;

R<sup>b</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl;

30 R<sup>c</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, Benzyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Acyl

bedeuten,  
wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup> und/oder R<sup>c</sup> ihrerseits eine bis vier Gruppen R<sup>w</sup> tragen können:

35 R<sup>w</sup> Halogen, Cyano, OR<sup>x</sup>, NHR<sup>x</sup>, SR<sup>x</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Aloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Acylamino, [1,3]Dioxolane-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, [1,3]Dioxane-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, wobei

$R^x$  Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl oder Benzyl bedeutet.

5

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, 2-Pyrimidine enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung pflanzenpathogener Schadpilze.

10

Aus WO-A 01/96314 sind fungizide Pyrimidine, die in 2-Stellung einen Cyanamino-substituenten tragen, bekannt. Weiterhin sind aus WO-A 03/43993 fungizide 2-Pyrimidyl-N-methoxyamidine bekannt.

15

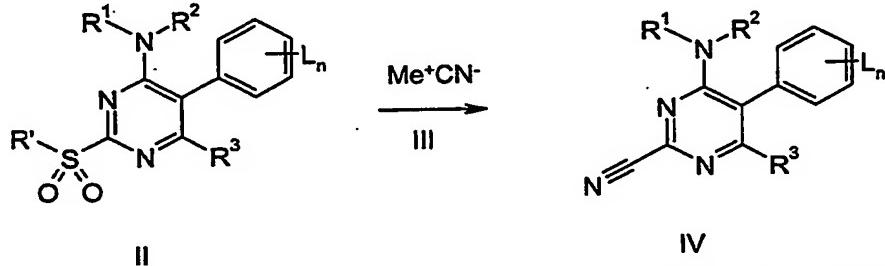
Die Wirkung der o.g. Pyrimidine ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

20

Demgemäß wurden die eingangs definierten Pyrimidine der Formel I gefunden. Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung sowie sie enthaltende Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen gefunden.

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden.

- 1) Beispielsweise kann von den Sulfonen der Formel II ausgegangen werden, deren Herstellung in WO-A 02/074753 oder DE 10156279.9 detailliert beschrieben ist. Durch Umsetzung der Sulfone II mit Metallcyaniden III ( $Me^+CN^-$ ) werden die Nitrite IV gewonnen. Unter Metallcyaniden sind in erster Linie Alkali- oder Erdalkalicyanide oder auch kovalente Cyanide wie Zinntetracyanid zu verstehen.

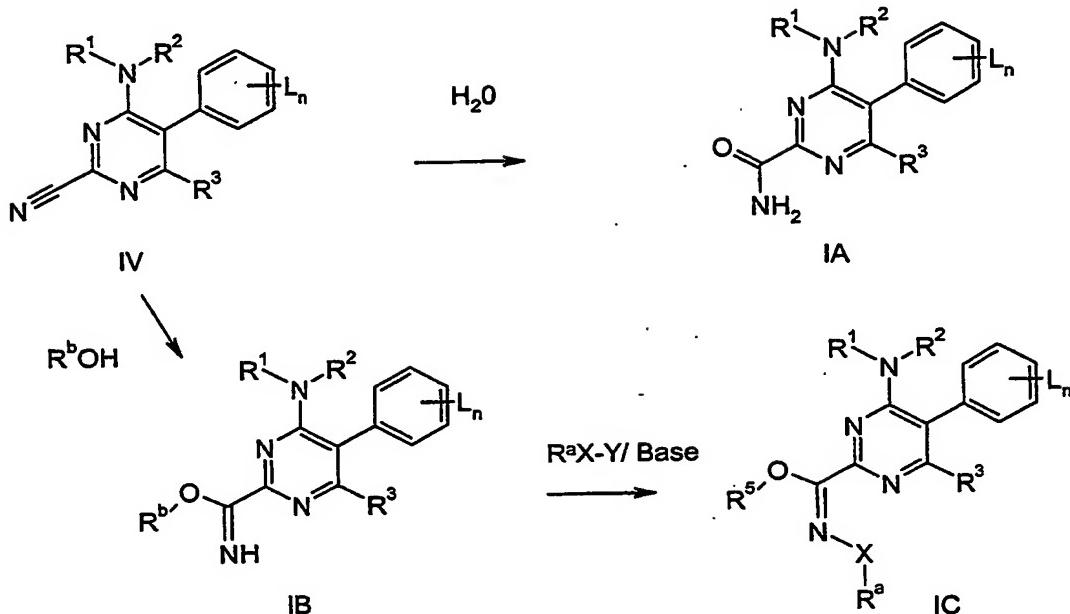


- 30 Der Austausch der Sulfonatgruppe gegen die Nitrilgruppe erfolgt nach literaturbekannten Methoden wie sie beispielsweise in WO-A 03/043993 beschrieben sind.

Die weitere Synthese kann wie in Schema 1 dargestellt erfolgen:

- 35 Schema 1:

4



Die Nitrilverbindung IV kann unter sauren oder vorzugsweise basischen Bedingungen zum Amid IA hydrolysiert werden. Die Hydrolyse erfolgt beispielsweise unter den von Katritzky et al. in Synthesis 1989, S. 949-950 beschriebenen Bedingungen (Wasserstoffperoxid, Base, polares aprotisches Lösungsmittel).

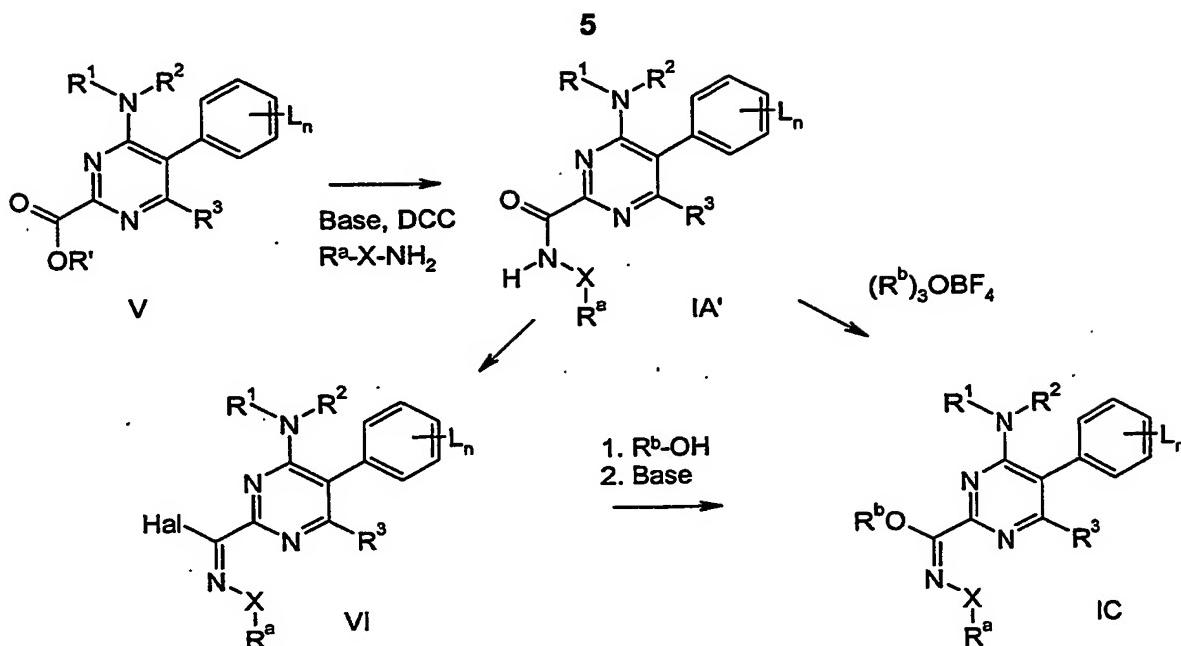
5 In Comprehensive Organic Chemistry, Vol 2, Sutherland, I.O. Pergamon Press, Oxford, 1979, S. 964 sind Hydrolysen von Nitrilen zu Amiden unter sauren Bedingungen beschrieben.

10 Alternativ hierzu kann das Pinneraddukt, das sich durch Anlagerung von in der Regel Salzsäure an das Nitril IV bildet, mit einem Alkohol der Formel  $\text{R}^b\text{OH}$ , wobei  $\text{R}^b$  die zuvor genannte Bedeutung besitzt, zum Iminoether der Formel IB umgesetzt werden. Die Alkylierung mit  $\text{R}^a\text{X-Y}$ , wobei  $\text{R}^a$  und das Brückenglied X die eingangs erwähnte Bedeutung hat und Y für eine Abgangsgruppe wie Halogenid, Sulfat oder Sulfonat steht, liefert Verbindungen des Typs IC.

15 15 Die Alkylierung mit  $\text{R}^a\text{-Y}$  kann ausgehend von Verbindung IB oder dem Nitril IV auch mit Meerwein Salzen der Formel  $(\text{R}^a)_3\text{OBF}_4$  analog den in Synth. Commun., 1983, 13, S. 753 oder Helv. Chim. Acta, 1986, 69, S. 1224 aufgeführten Vorschriften durchgeführt werden. Man gelangt zu Verbindungen I, wobei X für eine direkte Bindung steht.

20 Eine alternative Synthese der erfindungsgemäßen Verbindungen IA ist in Schema 2 aufgeführt.

Schema 2:

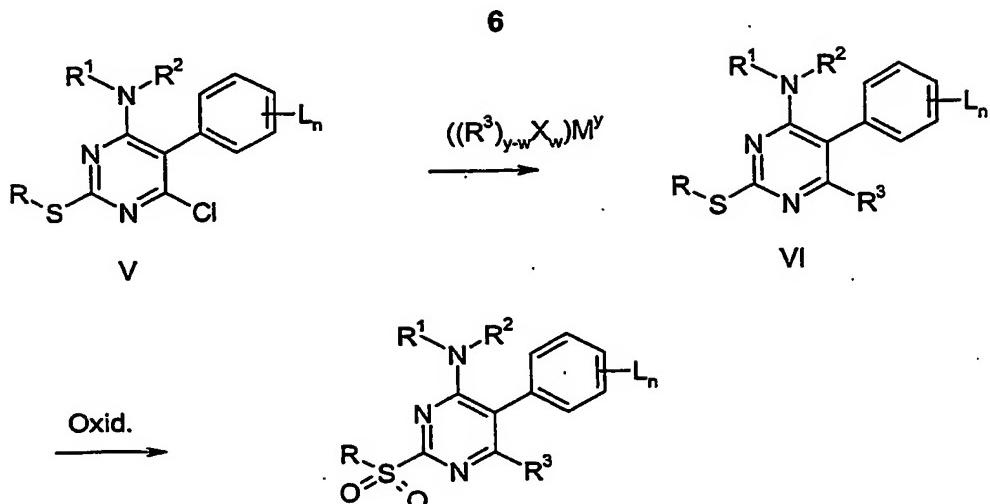


Die in Schema 2 aufgeführte Synthese der Verbindungen IA' und IC geht vom Ester der Formel V, welcher in der WO 03/043993 beschrieben ist, aus. Die Umsetzung von

- 5 V mit Aminen zu den Amiden IA' kann wie in Org.Lett., 2001, Vol 3, S. 1053-56 oder in J.Org.Chem., 2000, Vol 85, S. 8415-20 beschrieben, durchgeführt werden. Die anschließende Umsetzung mit Meerwein Salzen der Formel  $(R^b)_3OBF_4$  analog den in Synth. Commun., 1983, 13, S. 753 oder Helv. Chim.Acta, 1986, 69, S. 1224 aufgeführten Vorschriften führt zu den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel IC. Die
- 10 Iminhalogenide der Formel VI, wobei Hal für Halogen und insbesondere Chlor und Brom steht, sind analog Synthesis, 1991, Vol 9, S. 750-752 zugänglich. In einer Appel Reaktion werden beispielsweise mit Tetrabromkohlenstoff und Triphenylphosphin die entsprechenden Bromverbindungen hergestellt. Letztere lässt sich schließlich mit Alkoholen der Formel  $R^bOH$  und Basen zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IC umsetzen.
- 15

Der Rest  $R^3$  (insbesondere Alkyl) in 6-Position am Pyrimidinring kann durch Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse eingeführt werden. In manchen Fällen kann es ratsam sein die Reihenfolge umzudrehen und den Substituenten  $R^3$  vor dem Substituenten  $NR^1R^2$  einzuführen.

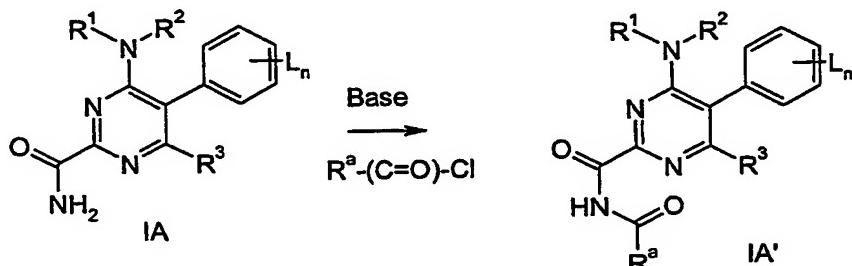
Schema 3:



In Formel  $(R^3)_{y-w}X_w-M^Y$  steht  $M$  für ein Metallion der Wertigkeit  $Y$ , wie beispielsweise  $B$ ,  $Zn$ ,  $Mg$ ,  $Cu$  oder  $Sn$ ,  $X$  steht für Chlor, Brom, Iod oder Hydroxy,  $R^3$  bedeutet bevorzugt  $C_1-C_4$ -Alkyl und  $w$  steht für eine Zahl von 0 bis 3. Diese Reaktion kann beispielsweise

- 5 analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

- 10 Der Substituent  $R^a$  in Formel IA' kann auch wie in Schema 4 gezeigt eingeführt werden.



- 15 Hierbei werden die Verbindungen der Formel **IA** mit Hilfe starker Basen zunächst ins Anion übergeführt und anschließend mit entsprechenden Säurechloriden zu **IA'** umgesetzt (s. J. Chem. Soc., Perkin Trans I, 1995, S. 3043). Man gelangt so zu Verbindungen, in denen  $X$  für ein  $C=O$  -Brückenglied steht. Als Basen für die Herstellung des Anions eignen sich beispielsweise Natriumamid und Natriumhydrid.

- 20 Die obengenannten Angaben beziehen sich insbesondere auf die Herstellung von Verbindungen, in denen  $R^3$  eine Alkylgruppe darstellt. Sofern  $R^3$  eine Cyangruppe oder einen Alkoxysubstuenten bedeutet, kann der Rest  $R^3$  durch Umsetzung mit Alkalimetallcyaniden bzw. Alkalimetallalkoholaten eingeführt werden.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

5 **Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;

**Alkyl sowie die Alkylteile von beispielsweise Alkoxy, Alkylamino, Alkoxyacarbonyl:** gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-

- 10 Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

- 15 **Halogenalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-difluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

- 20 **Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butene, 1-Methyl-2-butene, 2-Methyl-2-butene, 3-Methyl-2-butene, 1-Methyl-3-butene, 2-Methyl-3-butene, 3-Methyl-3-butene, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butene, 1,1-Dimethyl-3-butene, 1,2-Dimethyl-1-butene, 1,2-

Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-

5 Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

**Alkadienyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4, oder 6 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in beliebiger Position;

10 **Halogenalkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

15 **Alkinyl:** geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

30 **Cycloalkyl:** mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl;

fünf- bis sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

35 - **5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl,** enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Iothiazolidinyl, 4-

40

- Iothiazolidinyl, 5-Iothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl,  
2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-  
Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-  
Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-  
Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-  
Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl, 2,4-Dihydrofuran-2-yl, 2,4-  
Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-  
yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-  
3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazolin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-  
Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, 4-  
Isoxazolin-5-yl, 2-Iothiazolin-3-yl, 3-Iothiazolin-3-yl, 4-Iothiazolin-3-yl, 2-  
Isothiazolin-4-yl, 3-Iothiazolin-4-yl, 4-Iothiazolin-4-yl, 2-Iothiazolin-5-yl, 3-  
Isothiazolin-5-yl, 4-Iothiazolin-5-yl, 2,3-Dihdropyrazol-1-yl, 2,3-Dihdropyrazol-  
2-yl, 2,3-Dihdropyrazol-3-yl, 2,3-Dihdropyrazol-4-yl, 2,3-Dihdropyrazol-5-yl,  
3,4-Dihdropyrazol-1-yl, 3,4-Dihdropyrazol-3-yl, 3,4-Dihdropyrazol-4-yl, 3,4-  
Dihdropyrazol-5-yl, 4,5-Dihdropyrazol-1-yl, 4,5-Dihdropyrazol-3-yl, 4,5-  
Dihdropyrazol-4-yl, 4,5-Dihdropyrazol-5-yl, 2,3-Dihdrooxazol-2-yl, 2,3-  
Dihdrooxazol-3-yl, 2,3-Dihdrooxazol-4-yl, 2,3-Dihdrooxazol-5-yl, 3,4-  
Dihdrooxazol-2-yl, 3,4-Dihdrooxazol-3-yl, 3,4-Dihdrooxazol-4-yl, 3,4-  
Dihdrooxazol-5-yl, 3,4-Dihdrooxazol-2-yl, 3,4-Dihdrooxazol-3-yl, 3,4-  
Dihdrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl,  
2-Tetrahydropyran-yl, 4-Tetrahydropyran-yl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-  
Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydroimidinyl, 4-  
Hexahydroimidinyl, 5-Hexahydroimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-  
triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;
- **5-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei  
Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgrup-  
pen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis  
drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder ent-  
halten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-  
Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Iothiazolyl, 4-Iothiazolyl, 5-Iothiazolyl,  
3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-  
Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-  
yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-  
3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- **6-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome:  
6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein  
bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-

10

Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

- 5 - Ringsystem, das gegebenenfalls von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> bzw. von A und A' zusammen mit dem Stickstoff, an den sie gebunden sind, aufgespannt wird: Pyrrolidin, Morpholin, Piperidin oder Tetrahydropyrazol.

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Racemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

- 10 Im folgenden werden die Ausführungsformen der Erfindung genauer beschrieben.

- 15 Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Pyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl und R<sup>2</sup> für Wasserstoff stehen.

- 20 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für in α-Stellung verzweigtes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht.

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl und R<sup>2</sup> für Wasserstoff stehen.

- 25 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoff, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Sauerstoffatom unterbrochen sein kann und einen oder zwei C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsubstituenten tragen kann.

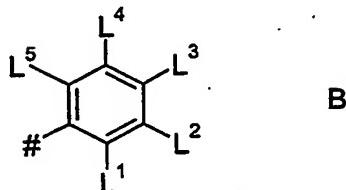
- 30 Insbesondere bevorzugt sind Gruppen NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> wie – insbesondere in α-Stellung – methylierte Pyrrolidine oder Piperidine. Weiterhin ist 4-Methylpiperidin bevorzugt.

- 35 Insbesondere werden Pyrimidine I bevorzugt, wobei die Substituenten L<sup>1</sup> bis L<sup>5</sup> die folgende Bedeutung haben:

L Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A,

- 40 A, A', A" unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl.

Außerdem werden Pyrimidine I bevorzugt, wobei die durch L<sub>n</sub> substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



- 5 steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidin-Gerüst ist und

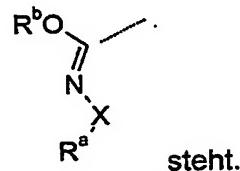
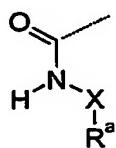
- L<sup>1</sup> Fluor, Chlor, CH<sub>3</sub> oder CF<sub>3</sub>;
- L<sup>2</sup>,L<sup>4</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, CH<sub>3</sub> oder Fluor;
- 10 L<sup>3</sup> Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, CH<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CO-NH<sub>2</sub>, CO-NHCH<sub>3</sub>, CO-NHC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, CO-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, NH-C(=O)CH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)-C(=O)CH<sub>3</sub> oder COOCH<sub>3</sub> und
- L<sup>5</sup> Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH<sub>3</sub> bedeuten.

- Besonders bevorzugt werden auch Verbindungen I, in denen R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet,  
15 das durch Halogen substituiert sein kann.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>3</sup> für Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy steht.

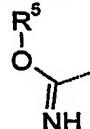
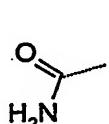
- 20 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>3</sup> Methyl, Cyano, Methoxy oder insbesondere Chlor bedeutet.

Geeignet im Hinblick auf ihre fungizide Wirkung sind Pyrimidine der Formel I, in der R<sup>4</sup> für



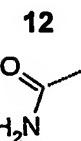
- 25 steht.

Weiterhin sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der R<sup>4</sup> für



steht.

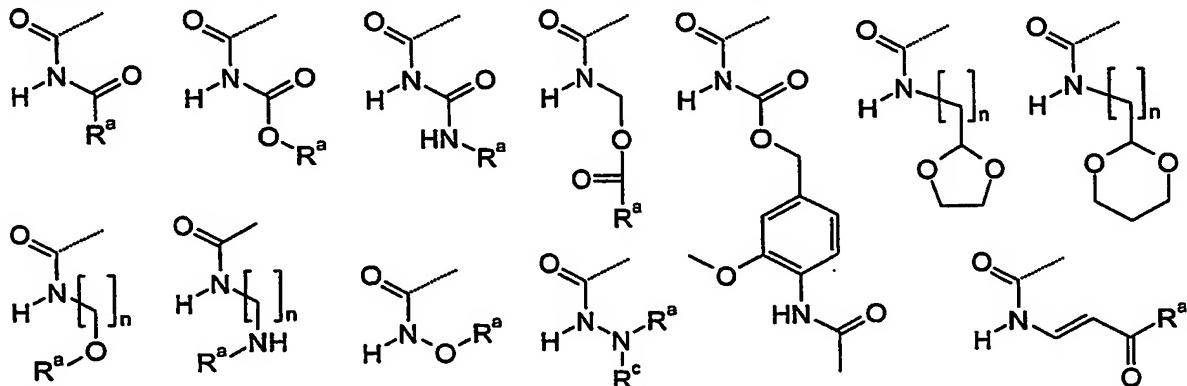
- 30 Insbesondere sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der R<sup>4</sup> für



steht.

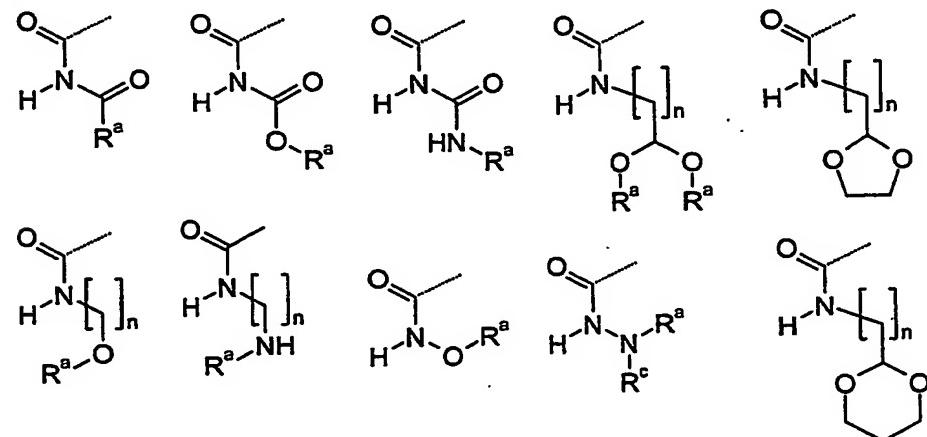
Schließlich kann R<sup>4</sup> bevorzugt die folgenden Bedeutungen haben, die auch als

- 5 prodrug-Restedefinitionen aufgefasst werden können (s. Medicinal Research Reviews 2003, 23, 763 – 793, oder J. of Pharmaceutical Sciences 1997, 86, 765-767):



Der Index n in den Alkenylenresten der obigen Formeln steht für eine ganze Zahl 1 bis 3.

- 10 Insbesondere bevorzugt sind die Restedefinitionen R<sup>4</sup>:



Das Brückenglied X steht bevorzugt für eine direkte Bindung und für -(C=O)-.

Der Substituent R<sup>a</sup> steht vorzugsweise für Wasserstoff, Methyl, Benzyl, Trifluormethyl,

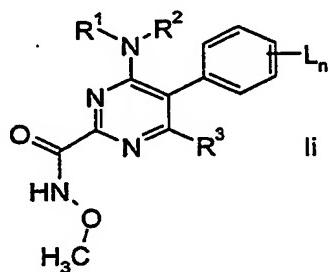
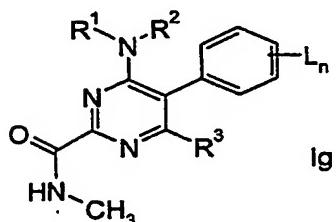
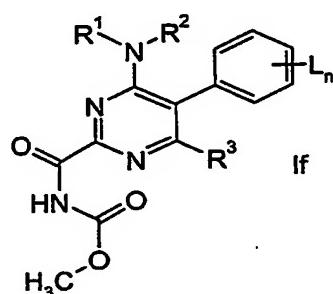
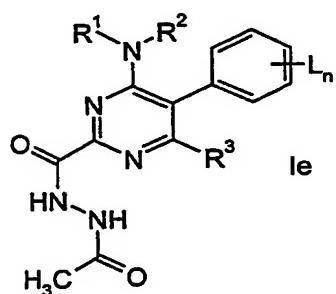
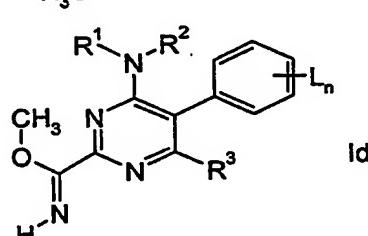
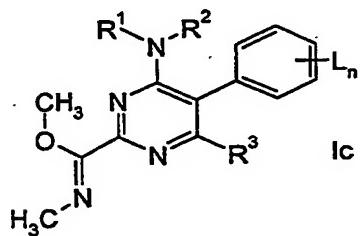
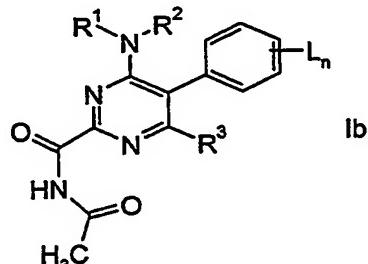
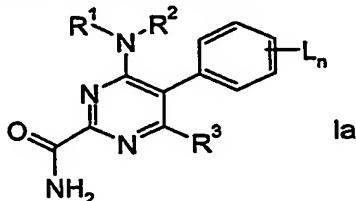
- 15 Allyl, Propargyl oder Methoxymethyl und besonders bevorzugt für Wasserstoff.

Der Substituent R<sup>b</sup> bedeutet bevorzugt Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl und insbesondere bevorzugt: Methyl, Allyl oder Propargyl.

- 20 Der Substituent R<sup>c</sup> bedeutet bevorzugt Wasserstoff oder Methyl.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der

- 5 Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.



**Tabelle 1**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 2**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

**Tabelle 3**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

**Tabelle 4**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

**Tabelle 5**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trifluor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

**Tabelle 6**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 7**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

**Tabelle 8**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-CN, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

**Tabelle 9**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dichlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 10**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

**Tabelle 11**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-chlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

**Tabelle 12**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-fluor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

**Tabelle 13**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dimethyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

**Tabelle 14**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-chlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 15**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

**Tabelle 16**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dimethyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

**Tabelle 17**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trimethyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
5 entspricht

**Tabelle 18**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-cyano, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
10 entspricht

**Tabelle 19**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
15 entspricht

**Tabelle 20**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer  
20 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 21**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
25 entspricht

**Tabelle 22**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer  
30 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 23**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-brom, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
35 entspricht

**Tabelle 24**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-cyan, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-  
40 spricht

**Tabelle 25**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-3-methyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

5 entspricht

**Tabelle 26**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-cyan, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

**Tabelle 27**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-brom, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

15 entspricht

**Tabelle 28**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer

20 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 29**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-brom, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

25 spricht

**Tabelle 30**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 31**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

35 Tabelle A entspricht

**Tabelle 32**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

40 Tabelle A entspricht

**Tabelle 33**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-methoxy, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5      Tabelle A entspricht

**Tabelle 34**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10     Tabelle A entspricht

**Tabelle 35**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15     Tabelle A entspricht

**Tabelle 36**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20     Tabelle A entspricht

**Tabelle 37**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25     Tabelle A entspricht

**Tabelle 38**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trifluor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 39**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35     Tabelle A entspricht

**Tabelle 40**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40     Tabelle A entspricht

**Tabelle 41**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-CN, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 42**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dichlor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

**Tabelle 43**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

**Tabelle 44**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-chlor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

**Tabelle 45**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-fluor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

**Tabelle 46**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dimethyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 47**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-chlor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

**Tabelle 48**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

**Tabelle 49**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dimethyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

5 spricht

**Tabelle 50**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trimethyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

**Tabelle 51**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-cyano, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabel-

15 le A entspricht

**Tabelle 52**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

20 belle A entspricht

**Tabelle 53**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile

25 der Tabelle A entspricht

**Tabelle 54**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

30 entspricht

**Tabelle 55**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile

35 der Tabelle A entspricht

**Tabelle 56**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-brom, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

40 entspricht

**Tabelle 57**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-cyan, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

5 spricht

**Tabelle 58**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-3-methyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

**Tabelle 59**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-cyan, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

15 entspricht

**Tabelle 60**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-brom, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

20 entspricht

**Tabelle 61**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile

25 der Tabelle A entspricht

**Tabelle 62**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-brom, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

30 spricht

**Tabelle 63**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

35 spricht

**Tabelle 64**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

40 belle A entspricht

**Tabelle 65**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 66**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-methoxy, R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 67**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 68**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 69**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 70**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 71**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trifluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 72**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 73**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 74**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-CN, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10

entspricht

**Tabelle 75**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dichlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

15

entspricht

**Tabelle 76**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

20

entspricht

**Tabelle 77**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-chlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

25

entspricht

**Tabelle 78**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

30

entspricht

**Tabelle 79**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dimethyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

35

entspricht

**Tabelle 80**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-chlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

40

entspricht

**Tabelle 81**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
5 entspricht

**Tabelle 82**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dimethyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
10 entspricht

**Tabelle 83**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trimethyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
15 entspricht

**Tabelle 84**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-cyano, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der  
20 Tabelle A entspricht

**Tabelle 85**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der  
25 Tabelle A entspricht

**Tabelle 86**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht  
30

**Tabelle 87**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A  
35 entspricht

**Tabelle 88**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer  
40 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 89**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-brom, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

5 entspricht

**Tabelle 90**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-cyan, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

**Tabelle 91**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-3-methyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

15 entspricht

**Tabelle 92**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-cyan, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

20 entspricht

**Tabelle 93**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-brom, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

25 entspricht

**Tabelle 94**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 95**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-brom, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

35 entspricht

**Tabelle 96**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

40 entspricht

**Tabelle 97**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

5 Tabelle A entspricht

**Tabelle 98**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

10 Tabelle A entspricht

**Tabelle 99**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-methoxy, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

15 Tabelle A entspricht

**Tabelle 100**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

20 spricht

**Tabelle 101**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

25 spricht

**Tabelle 102**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

30 spricht

**Tabelle 103**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

35 entspricht

**Tabelle 104**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trifluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

40 spricht

**Tabelle 105**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

5 entspricht

**Tabelle 106**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer

10 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 107**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-CN, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

15 spricht

**Tabelle 108**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dichlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

20 spricht

**Tabelle 109**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

25 spricht

**Tabelle 110**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 111**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

**Tabelle 112**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4-Dimethyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

**Tabelle 113**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

5 entspricht

**Tabelle 114**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

**Tabelle 115**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Dimethyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

15 spricht

**Tabelle 116**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,4,6-Trimethyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

20 entspricht

**Tabelle 117**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-cyano, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

25 belle A entspricht

**Tabelle 118**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-  
30 belle A entspricht

**Tabelle 119**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer

35 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 120**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

40 entspricht

**Tabelle 121**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer

5 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 122**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-brom, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

**Tabelle 123**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor-4-cyan, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

15 spricht

**Tabelle 124**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-3-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

20 entspricht

**Tabelle 125**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-cyan, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

25 entspricht

**Tabelle 126**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-brom, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 127**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer

35 Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 128**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor-4-brom, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

40 spricht

## Tabelle 129

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub>Pentafluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 spricht

## Tabelle 130

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub>2-Chlor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

10 Tabelle A entspricht

## Tabelle 131

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub>2-Fluor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

15 Tabelle A entspricht

## Tabelle 132

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih und II, in denen L<sub>n</sub>2-Methyl-4-methoxy, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

20 Tabelle A entspricht

## Tabelle A

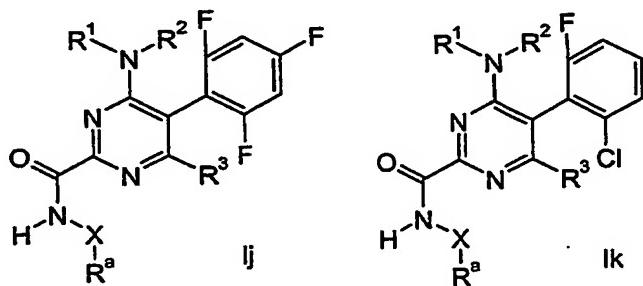
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-3	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-5	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-6	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-7	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-8	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	H
A-9	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>
A-10	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-11	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-12	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-13	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-14	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-15	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-16	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-17	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-18	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-19	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-20	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-21	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-22	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-23	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-24	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-25	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-26	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-27	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-28	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-29	(±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	H
A-30	(±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-31	(±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-32	(R) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	H
A-33	(R) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-34	(R) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-35	(S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	H
A-36	(S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-37	(S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-38	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-39	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-40	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-41	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-42	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-43	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-44	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-45	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-46	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-47	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-48	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-49	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-50	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-51	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-52	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-53	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-54	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-55	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-56	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-57	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-58	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-59	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-60	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-61	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-62	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-63	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-64	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-65	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-66	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-67	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-68	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-69	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-70	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-71	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-72	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-73	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-74	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-75	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-76	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-77	Cyclopentyl	H
A-78	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
A-79	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-80	Cyclohexyl	H
A-81	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-82	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-83	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
A-84	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-85	(R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-86	(S) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-87	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-88	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-89	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]-CH <sub>2</sub> -	

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-90	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-	
A-91	(±) -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-	
A-92	-CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -	
A-93	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
A-94	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-	
A-95	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-96	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-97	(R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-98	(S) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-99	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-100	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>  CH <sub>2</sub>	
A-101	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ] <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-102	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -	

Weiterhin sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.



- 10 Tabelle 133  
Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $\text{NR}^1\text{R}^2$  4-Methylpiperidin und  $\text{R}^3$  Methyl bedeuten und  $-\text{X}-\text{R}^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

15 Tabelle 134  
Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $\text{R}^1\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $\text{R}^2$  Wasserstoff und  $\text{R}^3$  Methyl bedeuten und  $-\text{X}-\text{R}^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 135**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**5 Tabelle 136**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R,S) CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**10 Tabelle 137**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R) CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**15 Tabelle 138**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (S) CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**20 Tabelle 139**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R,S) CH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**25 Tabelle 140**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R) CH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**30 Tabelle 141**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (S) CH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**35 Tabelle 142**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> 4-Methylpiperidin und R<sup>3</sup> Chlor bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 143**

## 35

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 144

- 5 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 145

- 10 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R,S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 146

- 15 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 147

- 20 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 148

- 25 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R,S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 149

- 30 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 150

- 35 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Chlor bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

## Tabelle 151

- 40 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $\text{NR}^1\text{R}^2$  4-Methylpiperidin und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 152**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

5 spricht

**Tabelle 153**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

10

**Tabelle 154**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R,S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

15

**Tabelle 155**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

20

**Tabelle 156**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

25

**Tabelle 157**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R,S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

30

**Tabelle 158**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(R)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

35

**Tabelle 159**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen  $R^1(S)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$ ,  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $-X-R^a$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

40

**Tabelle 160**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> 4-Methylpiperidin und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**5 Tabelle 161**

Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 162**

10 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 163**

15 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R,S) CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 164**

20 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R) CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 165**

25 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (S) CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 166**

30 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R,S) CH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 167**

35 Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup> (R) CH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

**Tabelle 168**

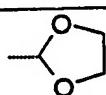
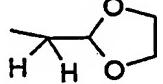
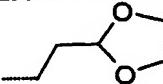
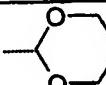
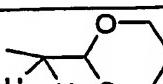
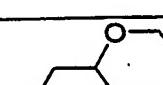
Verbindungen der Formel Ij oder Ik in denen R<sup>1</sup>(S) CH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und -X-R<sup>a</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

5

Tabelle B

Nr.	X	R <sup>a</sup>
B-1	-(C=O)-	H
B-2		CH <sub>3</sub>
B-3		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-4		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-5		CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-6		CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-7	-O-	H
B-8		CH <sub>3</sub>
B-9		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-10		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-11		CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-12		CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-13	-(C=O)-O-	H
B-14		CH <sub>3</sub>
B-15		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-16		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-17		CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-18		CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-19	-NH-	H
B-20		CH <sub>3</sub>
B-21		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-22		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-23		CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-24		CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-25	-(C=O)-NH-	H
B-26		CH <sub>3</sub>
B-27		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-28		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-29		CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-30		CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-31	direkte Bindung	H

Nr.	X	R <sup>a</sup>
B-32		CH <sub>3</sub>
B-33		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-34		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-35		CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-36		CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-37		CH <sub>2</sub> OH
B-38		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH
B-39		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH
B-40		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH
B-41		CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
B-42		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
B-43		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
B-44		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
B-45		CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-46		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-47		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-48		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
B-49		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
B-50		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
B-51		CH <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>
B-52		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>
B-53		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>
B-54		CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-55		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-56		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-57		CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-58		CH <sub>2</sub> SH
B-59		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SH
B-60		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SH
B-61		CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
B-62		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
B-63		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
B-64		CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-65		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-66		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-67		CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-68		CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
B-69		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

Nr.	X	R <sup>a</sup>
B-70		
B-71		
B-72		
B-73		
B-74		
B-75		
B-76		CH=CH <sub>2</sub>
B-77		CH=CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
B-78		CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
B-79		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
B-80		CH <sub>2</sub> C≡CH
B-81		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Oomyceten und Basidiomyceten. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 15 Alternaria-Arten an Gemüse und Obst,
- Bipolaris- und Drechslera-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- Blumeria graminis (echter Mehltau) an Getreide,

*Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,  
*Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,  
*Fusarium-* und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,  
*Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,

- 5    *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,  
      *Plasmopara viticola* an Reben,  
      *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,  
      *Pseudocercosporella herpotrichoides* an Weizen und Gerste,  
      *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,  
10    *Puccinia*-Arten an Getreide,  
      *Pyricularia oryzae* an Reis,  
      *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,  
      *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,  
      *Uncinula necator* an Reben,  
15    *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie  
      *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paeciliomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,  
20    Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch  
25    nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

30    Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

35    Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

5

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstreichen des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

15

Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykol-diacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

20

- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

30

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutynaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethoxyoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

35

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Me-

43

thanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerde, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein,

Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

15

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

20

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A) Wasserlösliche Konzentrate (SL)

25 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

30

B) Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiemittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

35

C) Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

40

## D) Emulsionen (EW, EO)

40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylo unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung

5 wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

## E) Suspensionen (SC, OD)

10 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

## F) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

15 50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion,

20 Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

## G) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

25 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

## 2. Produkte für die Direktapplikation

## H) Stäube (DP)

35 5 Gew. Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

## I) Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

5

J) ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikati-

10

on.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

15

20 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber 25 auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und even- tuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Ver- dünnung mit Wasser geeignet sind.

30

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

35 Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-%

Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können

zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zu-

5 zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

10

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

15

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin

20

- oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,

25

- Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,

30

- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuanimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenoxy, Pyroquilon, Quinoxyfen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,

35

- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel

40

- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Dicloromezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil,

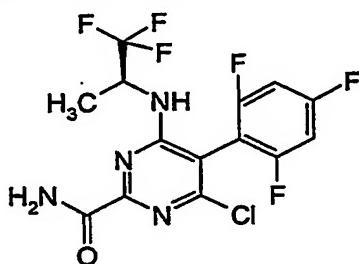
Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid

- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl,
- 5 Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

#### Synthesebeispiele

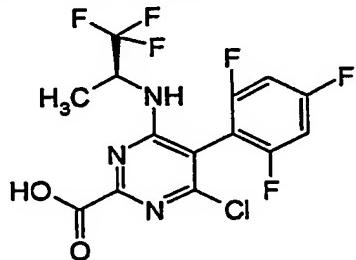
10

Beispiel 1: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonsäureamid [I-5]



Es wurden 5,0 g 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonitril (s. WO 03/04993, Seiten 28 und 29) in 5 ml DMSO vorgelegt, dazu wurden 344 mg K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>, gegeben und auf 10°C abgekühlt. Anschließend wurde 1,4 ml 30%iges H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> hinzugegeben. Es wurde 5 min. im Eisbad und danach noch 30 min bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wurde in 150 ml Wasser eingetragen. Dabei fiel das Amid aus. Das Amid wurde abfiltriert, gewaschen und im Hochvakuum getrocknet. Es wurden 4,7 g der beige gefärbten Titelverbindung vom Fp. 157-162°C erhalten.

Beispiel 2: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonsäure [I-11]



25

Es wurden 1,5 g 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonitril (s. WO 03/04993, Seiten 28 und 29) in 5 ml konz. H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> gelöst und 20 min bei 110°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde in 100 ml Eiswasser eingetragen und dabei fiel die Säure aus. Die Säure wurde abfiltriert, mit Wasser

gewaschen und im Hochvakuum getrocknet. Man erhielt 1,5 g der gelben Titelverbindung.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 1.4 (d, CH<sub>3</sub>), 4.85 (d, NH), 5.60-5.80 (m, CH), 6.90-7.00 (m, CH), 10.5 (s (breit), OH).

5

Beispiel 3: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonsäure-N-tert.butylamid [I-10]



10

- a) Zu 5 ml 40 °C warmen Thionylchlorid wurden 1,5 g der Säure (Beispiel 2) gegeben. Die Reaktionsmischung wurde gerührt bis die Gasentwicklung beendet war. Der Ansatz wurde mit Toluol versetzt und das Lösungsmittel sowie überschüssiges Thionylchlorid komplett abdestilliert. Es wurden 1,6 g eines dunkelgrünen Öls erhalten.

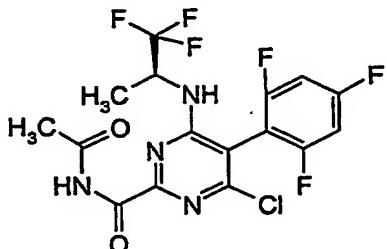
15

- b) Es wurden 38 mg tert-Butylamin und 58 mg Triethylamin in 7 ml THF bei 0°C vorgelegt, dazu wurde 200 mg des zuvor hergestellten Säurechlorid, gelöst in 2 ml THF gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 12 Std. bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wurde einrotiert, in Methyltert.butylether aufgenommen und mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde abgetrennt, über MgSO<sub>4</sub> getrocknet und eingeeignet. Das Rohprodukt wurde mittels präparativer HPLC gereinigt. Es wurden 21 mg der gelben Titelverbindung mit einem Fp. von 49-54°C erhalten.

20

25

Beispiel 4: Herstellung von 4-Chloro-6-((S)-2,2,2-trifluoro-1-methyl-éthylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonsäure-N-acetylimid [I-12]



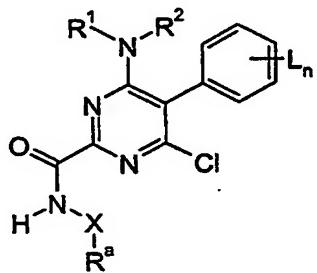
30

Es wurden 150 mg Amid (Beispiel 1) in 10 ml THF zusammen mit 20 mg Natriumhydrid unter Eisbadkühlung zur Reaktion gebracht und 30 min. nachgerührt. Dazu wurden 35 mg Essigsäurechlorid gelöst in 1 ml THF langsam zugegeben. Es wurde 30 min. bei Raumtemperatur nachgerührt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch mit Eiswas-

ser versetzt und mit Dichlormethan extrahiert. Die verreinigten organischen Phasen wurden über Mg<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> getrocknet und einrotiert. Es wurden 65 mg der rotbraunen Titelverbindung mit Fp. von 58 bis 65°C erhalten.

- 5 Die in den vorstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle I mit physikalischen Daten aufgeführt.

10 Tabelle I



Nr.	R <sup>a</sup> X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	L <sub>n</sub>	Fp. [°C]	<sup>1</sup> H-NMR [CDCl <sub>3</sub> , ppm]
I-1	H	(R,S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	2,4,6-Trifluor		0.80-0.90 (m, 2CH <sub>3</sub> ), 1.15 (d, CH5), 1.75-1.85 (m, CH), 4.25-4.30 (m, CH), 4.60 (s, NH), 6.75 (s, NH), 6.80-6.90 (m, 2CH), 7.70 (s, NH)
I-2	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluor	116-128	
I-3	H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	2-Chlor-6-fluor	208-210	
I-4	NH <sub>2</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	2-Chlor-6-fluor	103-108	
I-5	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	2,4,6-	157-	

				Trifluor	162	
I-6	NH <sub>2</sub>	(S) -CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	2,4,6-Trifluor	59-65	
I-7	H	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>	2,4,6-Trifluor	134-141	
I-8	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>	2,4,6-Trifluor	52-58	
I-9	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S) -CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	2,4,6-Trifluor	39-45	
I-10	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	(S) -CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	2,4,6-Trifluor	49-54	
I-11	-OH	(S) -CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	2,4,6-Trifluor		1.4(d, CH <sub>3</sub> ), 4.85 (d, NH), 5.60-5.80 (m, CH), 6.90-7.00 (m, CH), 10.5 (s(breit), OH)
I-12	(C=O)CH <sub>3</sub>	(S) -CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	2,4,6-Trifluor	58-65	

### Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden

5 Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt als Stammlösung formuliert mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt. Die

10 Stammlösungen der Wirkstoffe wurden entsprechend der angegebenen Konzentration mit Wasser verdünnt.

### Anwendungsbeispiele

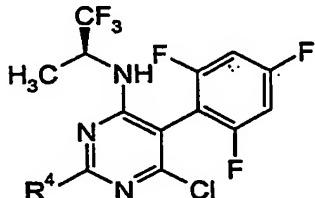
15 1. Wirkung gegen die Krautfäule an Tomaten verursacht durch *Phytophthora infestans* bei protektiver Behandlung

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "goldene Prinzessin" wurden mit einer wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe

## 51

besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporangienaufschwemmung von *Phytophthora infestans* infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 18 und 20°C aufgestellt. Nach 6 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten,

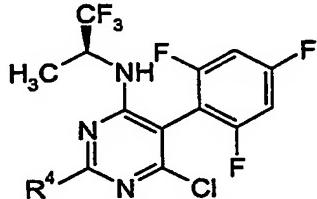
- 5 jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.



Nr.	R <sup>4</sup>	Dokument	Befall bei 250 ppm a.i. (%Blattfläche)
I-5	-(C=O)NH <sub>2</sub>	erfindungsgemäß	0
V1	-(C=NOCH <sub>3</sub> )NH <sub>2</sub>	WO 03/043993	80
	unbehandelt		80

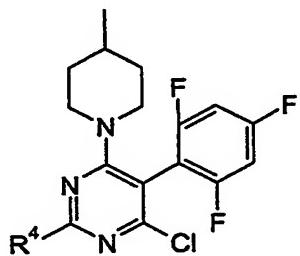
2. Dauerwirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch  
10 *Alternaria solani* bei protektiver Behandlung

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Um die Dauerwirkung zu testen wurden erst sieben Tage später die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von  $0.17 \times 10^6$  Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach weiteren 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.



Nr.	R <sup>4</sup>	Dokument	Befall bei 16 ppm a.i. (%Blattfläche)
I-5	(C=O)NH <sub>2</sub>	erfindungsgemäß	30
V1	(C=NOCH <sub>3</sub> )NH <sub>2</sub>	WO 03/043993	67
	unbehandelt		90

3. Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung
- 5 Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 - 3 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1.7 \times 10^6$  Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inkuliert. Anschließend 10 wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C, Dunkelheit und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

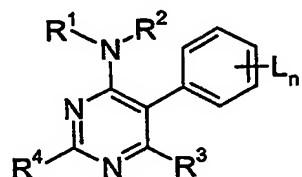


Nr.	R <sup>4</sup>	Dokument	Befall bei 16 ppm a.i. (%Blattfläche)
I-2	-(C=O)NH <sub>2</sub>	erfindungsgemäß	15
V2	-(C=NOCH <sub>3</sub> )NH <sub>2</sub>	Beispiel I-186 aus WO 03/043993	90
		unbehandelt	100

## 2-Substituierte Pyrimidine

## Zusammenfassung

- 5 Die Erfindung betrifft 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I



in der der Index n und die Substituenten R<sup>1</sup> bis R<sup>3</sup> sowie L wie in der Beschreibung definiert sind und

10 R<sup>4</sup> einer der Formeln



entspricht, in denen R<sup>a</sup>, X und R<sup>b</sup> wie in der Beschreibung definiert sind;

- 15 sowie Verfahren zu deren Herstellung, diese enthaltende pestizide Mittel und deren Verwendung als Pestizide.